



(19) BUNDESREPUBLIK

DEUTSCHLAND

DEUTSCHES
PATENTAMT

(12) Patentschrift

(10) DE 44 20 736 C 1

(51) Int. Cl. 6:

C 07 C 235/12

C 07 C 231/02

A 61 K 7/48

DE 44 20 736 C 1

- (21) Aktenzeichen: P 44 20 736.0-41
 (22) Anmeldetag: 15. 6. 94
 (43) Offenlegungstag: —
 (45) Veröffentlichungstag der Patenterteilung: 10. 8. 95

Innerhalb von 3 Monaten nach Veröffentlichung der Erteilung kann Einspruch erhoben werden

(73) Patentinhaber:

Henkel KGaA, 40589 Düsseldorf, DE

(72) Erfinder:

Möller, Hinrich, Dr., 40789 Monheim, DE; Engels, Thomas, Dr., 50226 Frechen, DE; Wachter, Rolf, Dr., 40595 Düsseldorf, DE; Busch, Peter, Dr., 40699 Erkrath, DE

(56) Für die Beurteilung der Patentfähigkeit in Betracht gezogene Druckschriften:

DE 42 14 895 A1

(54) Pseudoceramide

(57) Es werden Pseudoceramide der Formel I vorgeschlagen,



worin

R¹CO für einen Hydroxyacylrest mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen und 2 bis 7 Hydroxygruppen steht,

und

R² und R³ gleich oder verschieden sein können und für Wasserstoff, eine lineare oder verzweigte Alkylgruppe mit 1 bis 50 Kohlenstoffatomen, oder eine Gruppe mit der Formel

II

-R⁴-COO-R⁵worin R⁴ für eine Alkylengruppe mit 1 bis 18 Kohlenstoffatomen, die eine weitere Estergruppe, COO-R⁶, worin R⁶ eine lineare oder verzweigte Alkylgruppe mit 1 bis 50 Kohlenstoffatomen ist, enthalten kann, steht und R⁵ eine lineare oder verzweigte Alkylgruppe mit 6 bis 50 Kohlenstoffatomen ist, mit der Maßgabe, daß mindestens zwei der Gruppen R², R³, R⁵ und R⁶ langkettige Reste mit 6 bis 50 Kohlenstoffatomen darstellen oder mindestens eine der Gruppen R², R³, R⁵ und R⁶ ist eine verzweigte Alkylgruppe, wobei die Verzweigungen mindestens 6 Kohlenstoffatome aufweisen. Die Verbindungen eignen sich als "synthetic barrier lipids" zur Herstellung von Hautpflegemitteln.

DE 44 20 736 C 1

Beschreibung

Gebiet der Erfindung

5 Die Erfindung betrifft Pseudoceramide, die erhältlich sind durch Umsetzung von Zuckersäuren bzw. deren Lactonen mit Fettalkoholen von Aminosäuren, ein Verfahren zur Herstellung der Pseudoceramide, Hautpflegemittel mit einem Gehalt der Pseudoceramide sowie die Verwendung der Pseudoceramide zur Herstellung von Hautpflegemitteln.

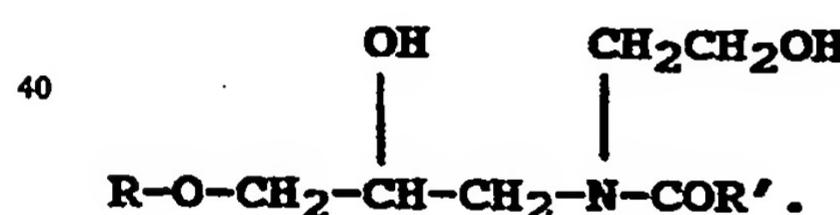
10 Stand der Technik

Für die Elastizität und das Aussehen der Haut spielt ein ausbalancierter Wasserhaushalt in den einzelnen Hauthschichten eine wichtige Rolle. In der Dermis und in der Grenzschicht der Epidermis nahe der Basalmembran ist der Gehalt an gebundenem Wasser am größten. Die Hautelastizität wird entscheidend durch die Collagenfibrillen in der Dermis geprägt, wobei die spezifische Konformation des Collagens durch den Einbau von Wassermolekülen erreicht wird. Eine Zerstörung der Lipid-Barriere im Stratum Corneum (SC) beispielsweise durch Tenside führt zu einem Anstieg des transepidermalen Wasserverlustes, wodurch die wäßrige Umgebung der Zellen gestört wird. Da das in tieferen Hauthschichten gebundene Wasser nur über Gefäße über die Körperflüssigkeit, nicht aber von außen zugeführt werden kann, wird deutlich, daß der Erhalt der Barrierefunktion des Stratum Corneum essentiell für den Gesamtzustand der Haut ist. [vgl. S.E. Friberg et al., C.R. 23. CED-Kongress, Barcelona, 1992, 5.29].

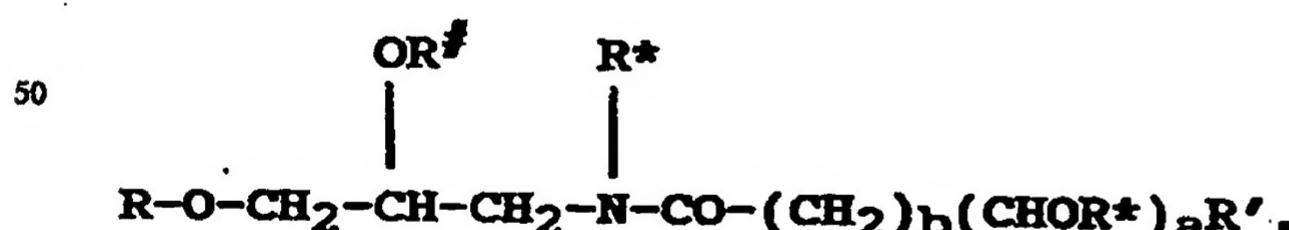
25 Ceramide stellen liphophile Amide langkettiger Fettsäure dar, die sich im allgemeinen von Sphingosin bzw. Phytosphingosin ableiten. Erhebliche Bedeutung hat diese Klasse von körpereigenen Feststoffen gewonnen, seitdem man sie im interzellulären Raum zwischen den Corneozyten als Schlüsselkomponenten für den Aufbau des Lipid-Bilayers, also der Permeabilitätsbarriere, im Stratum Corneum der menschlichen Haut erkannt hat. Ceramide haben Molekulargewichte von deutlich unter 1000, so daß bei äußerer Zufuhr in einer kosmetischen Formulierung das Erreichen des Wirkortes möglich ist. Die externe Applikation von Ceramiden führt zur Restaurierung der Lipidbarriere, wodurch den geschilderten Störungen der Hautfunktion ursächlich entgegengewirkt werden kann. [vgl. R.D. Petersen, Cosm. Toil. 107, 45 (1992)].

30 Dem Einsatz von Ceramiden sind infolge ihrer mangelnden Verfügbarkeit bislang Grenzen gesetzt. Es hat daher bereits Versuche gegeben, ceramidanaloge Strukturen, sogenannte "synthetic barrier lipids (SBL)" oder "Pseudoceramide" zu synthetisieren und zur Hautpflege einzusetzen. [vgl. G. Imokawa et al., J. Soc. Cosmet. Chem. 40, 273 (1989)].

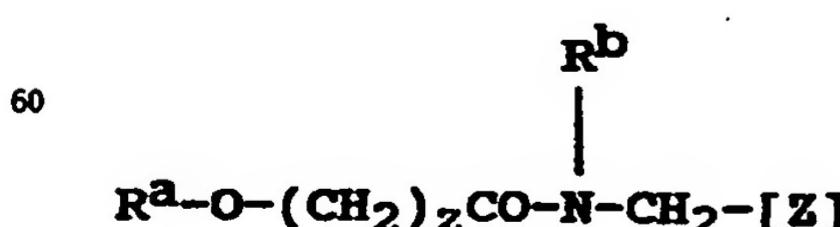
35 So werden beispielsweise in den Europäischen Offenlegungsschriften EP-A O 277 641 und EP-A O 227 994 (Kao) Ceramidanaloge der folgenden Struktur vorgeschlagen:



45 Aus den Europäischen Offenlegungsschriften EP-A O 482 860 und EP-A O 495 624 (Unilever) sind ceramidverwandte Strukturen der folgenden Formel bekannt:



55 Für den Schutz von Haut und Haaren werden in der Europäischen Patentanmeldung EP-A 0 455 429 (Unilever) ferner Zuckerderivate der folgenden Zusammensetzung vorgeschlagen:



65 Hierbei steht R^{a} für Wasserstoff oder einen ungesättigten Fettacylrest, z für Zahlen von 7 bis 49, A für einen Hydroxyalkyl- und Z für einen Zucker- oder Phosphatrest.

Ungeachtet dieser Versuche ist der Erfolg, der sich mit diesen Stoffen erzielen läßt, bislang unbefriedigend; insbesondere wird das Leistungsvermögen natürlicher Ceramide nicht erreicht. Ferner sind die Synthesesequen-

zen technisch aufwendig und daher kostspielig, was die Bedeutung der Substanzen zusätzlich relativiert.

Die Aufgabe der vorliegenden Erfindung liegt darin, neue leistungsstarke ceramidanaloge Strukturen zu entwickeln, die sich durch eine möglichst einfache Synthese auszeichnen. Eine weitere Aufgabe besteht darin, neue Pseudoceramide auf Basis nicht-tierischer Rohstoffe herzustellen.

Beschreibung der Erfindung

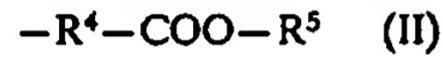
Gegenstand der Erfindung sind Pseudoceramide der Formel I



worin

R¹CO für einen Hydroxyacylrest mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen und 2 bis 7 Hydroxygruppen steht, und

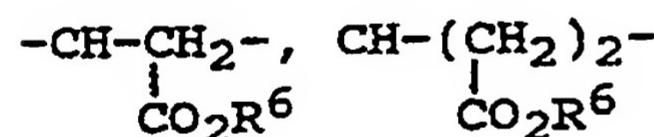
R² und R³ gleich oder verschieden sein können und für Wasserstoff, eine lineare oder verzweigte Alkylgruppe mit 1 bis 50 Kohlenstoffatomen, oder eine Gruppe mit der Formel II



worin R⁴ für eine Alkylengruppe mit 1 bis 18 Kohlenstoffatomen, die eine weitere Estergruppe, COO—R⁶, worin R⁶ eine lineare oder verzweigte Alkylgruppe mit 1 bis 50 Kohlenstoffatomen ist, enthalten kann, steht und R⁵ eine lineare oder verzweigte Alkylgruppe mit 6 bis 50 Kohlenstoffatomen ist, mit der Maßgabe, daß mindestens zwei der Gruppen R², R³, R⁵ und R⁶ langkettige Reste mit 6 bis 50 Kohlenstoffatomen darstellen oder mindestens eine der Gruppen R², R³, R⁵ und R⁶ ist eine verzweigte Alkylgruppe, wobei die Verzweigungen mindestens 6 Kohlenstoffatome aufweisen.

Überraschenderweise wurde gefunden, daß die im Sinne der Erfindung einzusetzenden Pseudoceramide die natürliche Barrierefunktion der Haut stärken, die Haut festigen und vor Austrocknung schützen. Die Stoffe sind den natürlichen Hautlipiden nachempfunden, dermatologisch und ökotoxikologisch unbedenklich und lassen sich homogen in die Ölphase kosmetischer Mittel einarbeiten. Sie sind weiß bzw. elfenbeinartig gefärbt, geruchsfrei, im Bereich des Haut-pH-Wertes hydrolysebeständig und farbstabil gegen Luftsauerstoff. Die erfindungsge-mäßen Pseudoceramide können auf Basis pflanzlicher Fettalkohole und Zucker, also ohne Mitverwendung unerwünschter tierischer Rohstoffe, hergestellt werden.

Besonders bevorzugt sind Pseudoceramide der Formel I, worin R¹ für einen Pentahydroxyhexylrest und R² für ein Wasserstoffatom stehen, wenn R³ einen R₁₈₋₃₆-Guerbetalkylrest, einen C₁₈₋₃₆-Guerbetalkoxycarbonyl-C₁₋₆-alkylrest oder eine Gruppe R⁴-COOR⁵, in der R⁴ für die Gruppen



steht

und R⁵ und R⁶ jeweils für einen C₁₂–C₁₈-Alkylrest stehen, darstellt; oder

R^2 für einen C_{12-18} -Alkylrest und R^3 für eine der Gruppen $-\text{CH}_2-\text{CO}_2R^6$ oder $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CO}_2R^6$, worin R^6 einen C_{12-18} -Alkylrest bedeutet, stehen; oder R^2 und R^3 für einen C_{12-18} -Alkylrest stehen.

Die Gruppen R², R³, R⁵ und R⁶ werden bevorzugt so ausgewählt, daß mindestens zwei der Gruppen langketige Reste mit 6 bis 50 Kohlenstoffatomen darstellen oder mindestens eine der Gruppen R², R³, R⁵ und R⁶ ist eine verzweigte Alkylgruppe, wobei die Verzweigungen mindestens 6 Kohlenstoffatome aufweisen. Durch eine derartige Auswahl der Gruppen kann eine Molekülstruktur erhalten werden, daß die erfindungsgemäßen Verbindungen einen hydrophilen Hydroxyalkylrest und zwei lipophile Alkylreste enthalten, wodurch ein guter Einbau der Verbindungen in die Bilayer-Struktur der Hornschichtlipide und damit eine Verbesserung der Barrierefähigkeit erreicht wird.

Herstellverfahren

Ein weiterer Gegenstand der Erfindung betrifft ein Verfahren zur Herstellung von Pseudoceramiden der Formel I

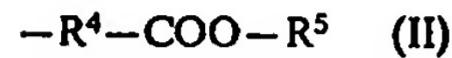


worin

R¹CO für einen Hydroxyacylrest mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen und 2 bis 7 Hydroxygruppen steht,

und

10 R² und R³ gleich oder verschieden sein können und für Wasserstoff, eine lineare oder verzweigte Alkylgruppe mit 1 bis 50 Kohlenstoffatomen, oder eine Gruppe mit der Formel II



worin R⁴ für eine Alkylengruppe mit 1 bis 18 Kohlenstoffatomen, die eine weitere Estergruppe, COO—R⁶, worin R⁶ eine lineare oder verzweigte Alkylgruppe mit 1 bis 50 Kohlenstoffatomen ist, enthalten kann, steht und R⁵ eine lineare oder verzweigte Alkylgruppe mit 6 bis 50 Kohlenstoffatomen ist, mit der Maßgabe, daß mindestens zwei der Gruppen R², R³, R⁵ und R⁶ langkettige Reste mit 6 bis 50 Kohlenstoffatomen darstellen oder mindestens eine der Gruppen R², R³, R⁵ und R⁶ ist eine verzweigte Alkylgruppe, wobei die Verzweigungen mindestens 6 Kohlenstoffatome aufweisen, worin man eine Verbindung mit der allgemeinen Formel III



25 worin R¹ die oben angegebene Bedeutung hat und R⁷ für eine Alkylgruppe mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, oder das Lacton mit der Formel (IV)



35 worin m für die Zahlen 0 bis 3 und n für die Zahlen 2 oder 3 stehen, der Aminolyse mit einem Amin mit der allgemeinen Formel (V)



worin R² und R³ die oben angegebene Bedeutung haben, unterwirft.

Ausgangsverbindungen

Als Ausgangsverbindungen zur Herstellung der Pseudoceramide der Erfindung sind C₁—C₄-Alkylester von Polyhydroxycarbonsäuren und deren Lactone geeignet. Als Polyhydroxycarbonsäuren kommen insbesondere solche mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen und 2 bis 7 Hydroxygruppen, d. h. sogenannte Zuckersäuren in Betracht. Typische Beispiele hierfür sind Glycerinsäure, Gluconsäure, Heptagluconsäure, Mannonsäure und Galactonsäure. Besonders bevorzugt werden die entsprechenden Lactone wie D-delta-Gluconolacton, D-gamma-Heptagluconolacton, L-Mannonsäure-gamma-lacton, D-Galactonsäure-delta-lacton sowie Glycerinsäuremethylester eingesetzt.

50 Die Ester bzw. Lactone mit den Formeln III bzw. IV werden in an sich bekannter Weise mit Aminoverbindungen mit der Formel V der Aminolyse unterworfen. Die Reaktion wird bevorzugt in Gegenwart eines Lösungsmittels wie einem niederen Alkylalkohol, vorzugsweise Methanol, bei Temperaturen zwischen 20°C und 65°C durchgeführt, wobei es vorteilhaft sein kann, das Amin unter Rühren zur Suspension/Lösung des Esters bzw. Lactons zu geben.

55 Als Aminoverbindungen, die mit den Zuckersäuren bzw. den Lactonderivaten zur Herstellung der erfindungsgemäßen Verbindungen umgesetzt werden können, kommen insbesondere primäre und sekundäre Alkylamine und natürlich vorkommende oder synthetische Aminosäuren in Betracht. Als Beispiele für die erfindungsgemäß eingesetzten Amine können Verbindungen genannt werden, worin R² und R³ für einen linearen oder verzweigten Alkylrest mit 1 bis 50 Kohlenstoffatomen stehen. Als Beispiele für diese Amine können Fettamine, insbesondere Difettalkylamine, wie Dihexadecylamin, Dioctadecylamin, Didodecylamin, Didecylamin, Dioctylamin sowie Guerbetamine genannt werden. Als technische Fettamine kommen insbesondere solche auf pflanzlicher Basis wie Kokosamin, Palmkernamin oder Oleylamin sowie die Guerbetamine in Betracht.

60 Als weitere Aminoverbindungen können auch die Ester von natürlichen und synthetischen Aminosäuren eingesetzt werden, die unter die Formel V fallen, wie beispielsweise Aminomono- oder Dicarbonsäuren. Als bevorzugte Beispiele für geeignete diesen Estern zugrunde liegende Aminosäuren können 2-Aminofettsäuren, Glycin, Alanin, N-C₈—C₂₂-Alkyl-β-alanin, L-, D,L-Asparaginsäure, L-, D,L-Glutaminsäure oder Aminomalonsäure eingesetzt werden. Es können auch Gemische von Aminosäuren eingesetzt werden.

65 Die Aminosäuren können mit den Alkoholen R⁶OH, worin R⁶ 6 bis 50 Kohlenstoffatome aufweist, verestert

sein, wobei Aminosäureester bevorzugt sind, die zwei lange Kohlenstoffketten aufweisen. Als Alkohole kommen insbesondere lineare primäre Alkohole und verzweigte primäre Alkohole in Betracht. Beispiele für lineare Alkohole sind die nativen Fettalkohole auf pflanzlicher Basis, wie z. B. Laurylalkohol, Myristylalkohol, Cetylalkohol, Stearylalkohol, Behenalkohol, Oleylalkohol, Elaidylalkohol, Ricinolalkohol, Linoleylalkohol, Linolenylalkohol sowie deren technischen Gemische, wie Kokosfettalkohol, Talgölfettalkohol, Palm- und Palmkernfettalkohol oder auch Erdnußfettalkohol.

Typische Beispiele für verzweigte primäre Alkohole sind 2-Ethylhexanol, Isotridecylalkohol, Isopalmitylalkohol und Isostearylalkohol. Als Ausgangsstoffe besonders bevorzugt sind Guerbetalkohole mit 12 bis 36 Kohlenstoffatomen, die man durch Kondensation von linearen Fettalkoholen in Gegenwart basischer Katalysatoren erhält. Typische Beispiele hierfür sind 2-Hexyldecanol, 2-Octyldodecanol, 2-Decyltetradecanol, 2-Dodecylhexadecanol, 2-Tetradecyloctadecanol und 2-Hexadecyleicosanol.

Hautpflegemittel

Die Pseudoceramide können in Hautpflegemitteln in Mengen von 1 bis 50, vorzugsweise von 1 bis 30, insbesondere von 2 bis 10 Gew.-% — bezogen auf die Mittel — enthalten und dabei sowohl als "Wasser-in-Öl" als auch "Öl-in-Wasser"-Emulsionen vorliegen; weitere übliche Hilfs- und Zusatzstoffe können in Mengen von 5 bis 95, vorzugsweise 10 bis 80 Gew.-% enthalten sein. Ferner können die Formulierungen Wasser in einer Menge bis zu 99 Gew.-%, vorzugsweise 5 bis 80 Gew.-% aufweisen.

Als Trägeröle kommen hierzu beispielsweise in Betracht: Mineralöle, Pflanzenöle, Siliconöle, Fettsäureester, Dialkylether, Fettalkohole und Guerbetalkohole. Als Emulgatoren können beispielsweise eingesetzt werden: Sorbitanester, Monoglyceride, Polysorbate, Polyethylenglycolmono/difettsäureester, hochethoxylierte Fettsäureester sowie hochmolekulare Siliconverbindungen, wie z. B. Dimethylpolysiloxane mit einem durchschnittlichen Molekulargewicht von 10.000 bis 50.000. Weitere Zusatzstoffe können sein: Konservierungsmittel wie z. B. p-Hydroxybenzoësäureester; Antioxidantien, wie z. B. Butylhydroxytoluol, Tocopherol; Feuchthaltemittel, wie z. B. Glycerin, Sorbitol, 2-Pyrrolidin-5-carboxylat, Dibutylphthalat, Gelatine, Polyglycole mit einem durchschnittlichen Molekulargewicht von 200 bis 600; Puffer, wie z. B. Milchsäure/TEA oder Milchsäure/NaOH; milde Tenside, wie z. B. Alkyloligoglucoside, Fettalkoholethersulfate, Fettsäureisothionate, -tauride und -sarcosinate, Ethercarbonsäuren, Sulfosuccinate, Eiweißhydrolysate bzw. -fettsäurekondensate, Sulfotriglyceride, kurzkettige Glucamide; Phospholipide, Wachse, wie z. B. Bienenwachs, Ozokeritwachs, Paraffinwachs; Pflanzenextrakte, z. B. von Aloe vera; Verdickungsmittel; Farb- und Parfumstoffe, sowie Sonnenschutzmittel, wie z. B. ultrafeines Titandioxid oder organische Stoffe wie p-Aminobenzoësäure und deren Ester, Ethylhexyl-p-methoxyimtsäureester, 2-Ethoxyethyl-p-methoxyimtsäureester, Butylmethoxydibenzoylmethan und deren Mischungen.

In einer bevorzugten Ausführungsform der Erfindung können die Pseudoceramide mit konventionellen Ceramiden, weiteren Pseudoceramiden Cholesterin, Cholesterinfettsäureestern, Fettsäuren, Triglyceriden, Cerebroiden, Phospholipiden und ähnlichen Stoffen, abgemischt werden, wobei Liposomen entstehen können.

In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform der Erfindung können die Pseudoceramide mit Wirkstoffbeschleunigern, insbesondere mit etherischen Ölen, wie beispielsweise Eucalyptol, Menthol und ähnlichen abgemischt werden.

In einer dritten bevorzugten Ausführungsform können die Pseudoceramide schließlich auch in Squalen oder Squalan gelöst und gegebenenfalls mit den anderen genannten Inhaltsstoffen zusammen mit flüchtigen oder nichtflüchtigen Siliconverbindungen als wasserfreie oder beinahe wasserfreie einphasige Systeme formuliert werden. Weitere Beispiele zu Bestandteilen und typischen Zusammensetzungen können beispielsweise der WO 90/01323 (Bernstein) und S.E. Friberg, J. Soc. Cosmet. Chem. 41, 155 (1990) entnommen werden.

Gewerbliche Anwendbarkeit

Die im Sinne der Erfindung als "synthetic barrier lipids" einzusetzenden Pseudoceramide stärken die natürliche Barrierefunktion der Haut gegenüber äußeren Reizen. Sie verbessern Festigkeit, Geschmeidigkeit und Elastizität der Haut, steigern den Feuchtigkeitsgehalt und schützen die Haut vor Austrocknung; zugleich werden feinste Falten geglättet.

Ein weiterer Gegenstand der Erfindung betrifft daher die Verwendung von Pseudoceramiden der Formel I als "synthetic barrier lipids" zur Herstellung von Hautpflegemitteln, in denen sie in Mengen von 1 bis 50, vorzugsweise von 1 bis 30, insbesondere von 2 bis 10 Gew.-% — bezogen auf die Mittel — enthalten sein können. Aber auch spezielle Formulierungen, die flüssigkristalline, lamellare Strukturen bilden, sind zur Erhaltung der Barrierefunktion der Haut besonders vorteilhaft. Diese Formulierungen können angelehnt an die Zusammensetzung der Hornschichtlipide als Hauptbestandteile 5 Gew.-% bis 50 Gew.-% einer Verbindung mit der Formel I, 25 Gew.-% bis 75 Gew.-% gesättigte und ungesättigte Fettsäuren, deren Alkalosalze oder Gemische der Fettsäuren und ihren Salzen, 10 Gew.-% bis 50 Gew.-% Cholesterin, Phytosterine und/oder Cholesterylsulfat, 5 Gew.-% bis 30 Gew.-% Triglyceride (Triolein) und Wachsester, und 2 Gew.-% bis 20 Gew.-% Phospholide, wie Lecithine oder Kephaline, enthalten. Typische Beispiele für derartige Formulierungen sind Hautcremes, Softcremes, Nährcremes, Sonnenschutzcremes, Nachtcremes, Hautöle, Pflegelotionen und Körper-Aerosole.

Die folgenden Beispiele sollen den Gegenstand der Erfindung näher erläutern, ohne ihn darauf einzuschränken.

Beispiele

N—D-Gluconoyl-L-asparaginsäure-di-C_{16/18}-alkylester

Zu der gerührten Suspension von 17,8 g (0,1 Mol) D-5-Gluconolacton in 150 ml Methanol wurden bei 65°C unterhalb von 10 Min. 58,2 g (0,1 Mol) L-Asparaginsäure-di-C_{16/18}-alkylester portionsweise gegeben und das Gemisch wurde noch 1,5 Stunden zum Sieden erhitzt. Anschließend wurde das Lösungsmittel unter verminderter Druck weitgehend abdestilliert. In nahezu quantitativer Ausbeute (74 g) wurde N-D-Gluconoyl-L-asparaginsäuredi-C_{16/18}-alkylester als farblose wachsartige Substanz mit unscharfem Schmelzpunkt zwischen 60°C und 80°C erhalten. Die Verbindung kann durch Umkristallisieren aus n-Hexan gereinigt werden, ist aber als Rohprodukt schon sehr rein (DC-Kontrolle).

In analoger Weise wurden die folgenden Verbindungen als farblose wachsartige Substanzen erhalten:

- N-D-Gluconoyl-L-asparaginsäure-dioctadecylester
- N-D-Gluconoyl-L-glutaminsäure-dioctadecylester
- N-D-Heptagluconoyl-L-glutaminsäure-octadecyl/docosyl-1 : 1-mischester
- N-D-Gluconoylglycin-C-32/36-Guerbetalkylester
- N-D-Gluconoyl-L-alanin-C_{24/28}-Guerbetalkylester

15

Patentansprüche

1. Pseudoceramide mit der allgemeinen Formel I

20



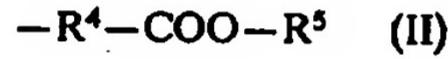
25

worin

R¹CO für einen Hydroxyacylrest mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen und 2 bis 7 Hydroxygruppen steht, und

30

R² und R³ gleich oder verschieden sein können und für Wasserstoff, eine lineare oder verzweigte Alkylgruppe mit 1 bis 50 Kohlenstoffatomen, oder eine Gruppe mit der Formel II



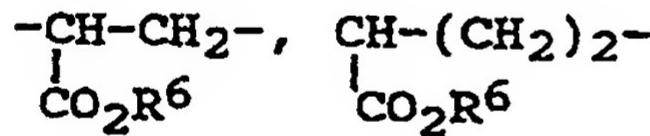
35

worin R⁴ für eine Alkylengruppe mit 1 bis 18 Kohlenstoffatomen, die eine weitere Estergruppe, COO—R⁶, worin R⁶ eine lineare oder verzweigte Alkylgruppe mit 1 bis 50 Kohlenstoffatomen ist, enthalten kann, steht und R⁵ eine lineare oder verzweigte Alkylgruppe mit 6 bis 50 Kohlenstoffatomen ist, mit der Maßgabe, daß mindestens zwei der Gruppen R², R³, R⁵ und R⁶ langketige Reste mit 6 bis 50 Kohlenstoffatomen darstellen oder mindestens eine der Gruppen R², R³, R⁵ und R⁶ ist eine verzweigte Alkylgruppe, wobei die Verzweigungen mindestens 6 Kohlenstoffatome aufweisen.

40

2. Pseudoceramide nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß R¹ für einen Pentahydroxyhexylrest und R² für ein Wasserstoffatom stehen, wenn R³ einen R₁₈₋₃₆-Guerbetalkylrest, einen C₁₈₋₃₆-Guerbetalkoxycarbonyl-C₁₋₆-alkylrest oder eine Gruppe R⁴—COOR⁵, in der R⁴ für die Gruppen

45



50

steht und R⁵ und R⁶ jeweils für einen C₁₂₋₁₈-Alkylrest stehen, darstellt; oder R² für einen C₁₂₋₁₈-Alkylrest und R³ für eine der Gruppen —CH₂—CO₂R⁶ oder —CH₂—CH₂—CO₂R⁶, worin R⁶ einen C₁₂₋₁₈-Alkylrest bedeutet, stehen; oder

R² und R³ für einen C₁₂₋₁₈-Alykrest stehen.

3. Verfahren zur Herstellung einer Verbindung mit der Formel I

55



60

worin

R¹CO für einen Hydroxyacylrest mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen und 2 bis 7 Hydroxygruppen steht, und

65

R² und R³ gleich oder verschieden sein können und für Wasserstoff, eine lineare oder verzweigte Alkylgruppe mit 1 bis 50 Kohlenstoffatomen, oder eine Gruppe mit der Formel II



DE 44 20 736 C1

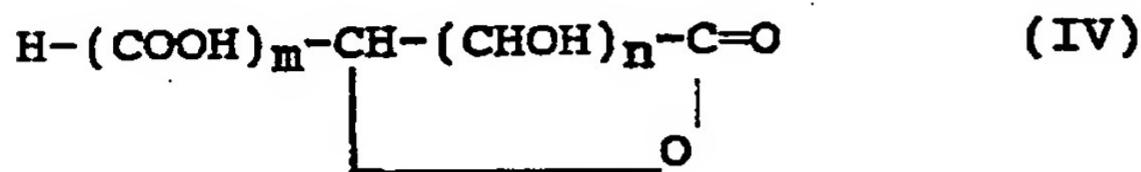
worin R⁴ für eine Alkylengruppe mit 1 bis 18 Kohlenstoffatomen, die eine weitere Estergruppe, COO—R⁶, worin R⁶ eine lineare oder verzweigte Alkylgruppe mit 1 bis 50 Kohlenstoffatomen ist, enthalten kann, steht und R⁵ eine lineare oder verzweigte Alkylgruppe mit 6 bis 50 Kohlenstoffatomen ist, mit der Maßgabe, daß mindestens zwei der Gruppen R², R³, R⁵ und R⁶ langketige Reste mit 6 bis 50 Kohlenstoffatomen darstellen oder mindestens eine der Gruppen R², R³, R⁵ und R⁶ ist eine verzweigte Alkylgruppe, wobei die Verzweigungen mindestens 6 Kohlenstoffatome aufweisen, worin man eine Verbindung mit der allgemeinen Formel III

5

R¹COOR⁷ (III)

10

worin R¹ die oben angegebene Bedeutung hat und R¹ für eine Alkylgruppe mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, oder das Lacton mit der Formel IV



15

worin m für die Zahlen 0 bis 3 und n für die Zahlen 2 oder 3 stehen, der Aminolyse mit einem Amin mit der allgemeinen Formel V

20

HNR²R³ (V)

25

worin R² und R³ die oben angegebene Bedeutung haben, unterwirft.

4. Verfahren nach Anspruch 3, dadurch gekennzeichnet, daß man als Verbindung mit der Formel III einen Zuckersäuremethylester einsetzt.

30

5. Verfahren nach Anspruch 3, dadurch gekennzeichnet, daß man als Verbindung mit der Formel IV D-delta-Glyconolacton einsetzt.

35

6. Verfahren nach einem der Ansprüche 3 bis 5, dadurch gekennzeichnet, daß man als Verbindung mit der Formel V einen Aminosäureester einsetzt, der zwei lange Kohlenstoffketten aufweist.

40

7. Verfahren nach einem der Ansprüche 3 bis 5, dadurch gekennzeichnet, daß man als Verbindung mit der Formel V ein Difettalkylamin einsetzt.

45

8. Verfahren nach einem der Ansprüche 3 bis 5, dadurch gekennzeichnet, daß man als Verbindung mit der Formel V ein Guerbetfettalkylamin einsetzt.

50

9. Verwendung von Pseudoceramiden nach Anspruch 1 als Bestandteil von "synthetic barrier lipids" zur Herstellung von Hautpflegemitteln.

55

60

65

- Leerseite -